

⑫ 公開特許公報(A)

昭62-48677

⑮ Int. Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑬ 公開 昭和62年(1987)3月3日

C 07 D 311/62
// A 61 K 31/35

ACJ

6640-4C

審査請求 有 発明の数 1 (全2頁)

⑭ 発明の名称 新タンニン

⑰ 特 願 昭61-200801

⑱ 出 願 昭56(1981)12月12日

⑲ 特 願 昭56-200669の分割

特許法第30条第1項適用 昭和56年10月2日 日本生薬学会開催の「日本生薬学会第28回年会(東京)」において講演要旨集をもつて発表

⑳ 発 明 者 西 岡 五 夫

福岡市南区大字老司60番地

㉑ 発 明 者 野 中 源 一 郎

福岡市西区田島1丁目1番334号

㉒ 出 願 人 日本新薬株式会社

京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14番地

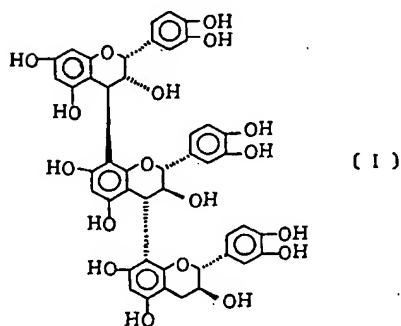
㉓ 代 理 人 弁理士 片 岡 宏

明 細 書

1. 発明の名称

新 タ ニ ン

2. 特許請求の範囲



で表わされる化合物。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬品として有用な新規タンニンに関する。

タンニンは広く植物界に分布し、収斂作用のあることが古くから知られ、収斂薬として、また皮を革に変化させるなめし剤として多く用いられてきた。

タンニンは分子量 600~2000ほどの植物の微量成分で複雑な構造を有しており、単離精製の困難さとあいまって研究が遅れていた。

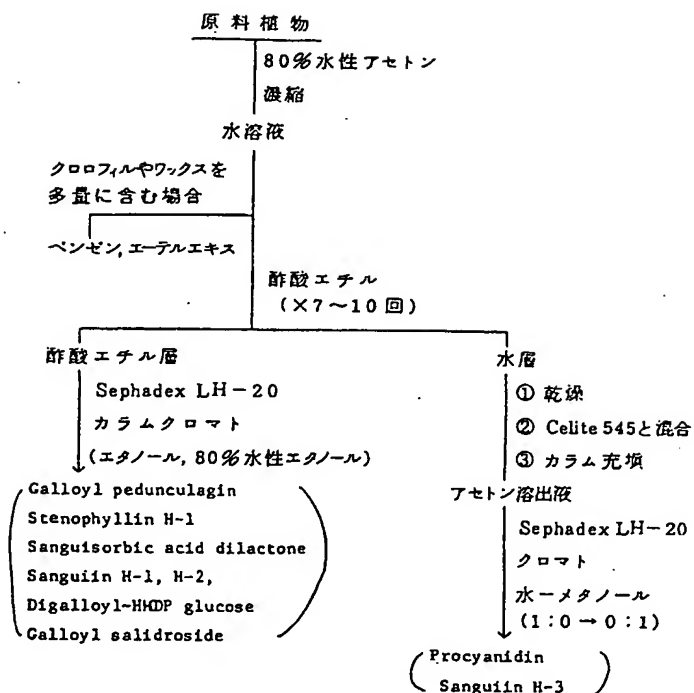
一方、従来より、地榆等の植物が、酵素阻害作用等に基づく有用な医薬的效果を有することが知られていた。

本発明者らは、これらの植物の薬効成分を検索する目的でこれらに含まれる成分を単離取得して薬理効果を調べた結果、幸運にも新規なるタンニンに酵素阻害作用のあることを見出し本発明を完成した。

本発明に係る化合物は、体中酵素蛋白と結合することによってその活性を低下させる作用を有している。

本発明に係る化合物は、例えば、びんろうじ等の植物から、アセトンによる抽出、酢酸エチル：水の分配、あるいはカラムクロマト等の公知の方法により容易に得ることができる。

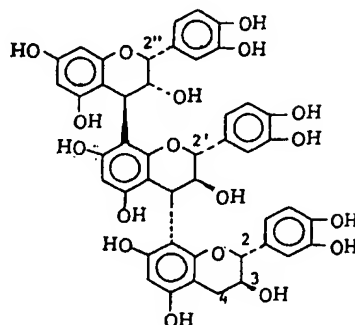
これらの方法を総括して示せば、例えば次のようである。



以下に本発明化合物の所得方法の実施例を掲げて本発明を詳細に説明する。

実施例 1

びんろうじ 1.2g を60%の水性アセトン1ℓで抽出し、アセトンを留去後、析出する褐色沈澱を濾去。濾液を酢酸エチル1ℓで10回分配し、水層をCelite 545と混合し、風乾する。これをカラムにつめ、アセトンで溶出する。溶出液の溶媒を留去後、Sephadex LH-20で水ついで順次メタノールを加えて溶出したところ、40mgの黄かっ色の無定形粉末を得た。



以上

Procyanidin C-4 黄かっ色無定形粉末 (収率 0.0028%)

$[\alpha]_D - 97.4^\circ$ (acetone, $c=0.5$)

PMR (DMSO- d_6 /Pyridin- d_5) 150°C ppm: 2.75 ~ 3.20 (2H, m, C_4 -H), 4.03 (1H, br.s, C_3'' -H), 4.03 ~ 4.22 (1H, m, C_3 -H), 4.28 (1H, d, $J=5$ Hz, C_4' -H), 4.62 (1H, t, $J=5$ Hz, C_3' -H), 4.68 (1H, d, $J=5$ Hz, C_2 -H), 4.80 (1H, br.s, C_4'' -H), 4.82 (1H, d, $J=5$ Hz, C_2 -H), 5.40 (1H, br.s, C_2'' -H), 5.86 ~ 6.24 (4H in total, 6, 6', 6'', 8")